

### ЗД-35. РЕАКЦИЯ КАТАЛИТИЧЕСКОГО ЦИКЛОМАГНИРОВАНИЯ 1,2-ДИЕНОВ В СТЕРЕОСЕЛЕКТИВНОМ СИНТЕЗЕ ПОЛИФУНКЦИОНАЛЬНЫХ МАКРОДИОЛИДОВ

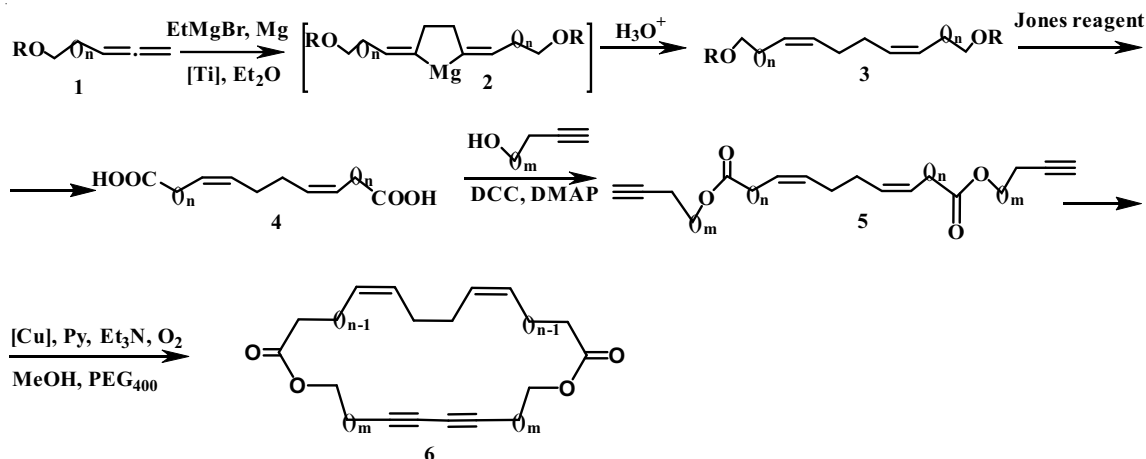
В. А. Дьяконов, И. И. Исламов, У. М. Джемилев

Институт нефтехимии и катализа РАН,  
450075, Россия, Уфа, пр. Октября, 141

E-mail: iislamovi@gmail.com

В работе представлен первый пример каталитического синтеза макродиолидов, содержащих в своей структуре 1Z,5Z-диеновые и 1,3-диеновые фрагменты и перспективных в качестве противоопухолевых и антибактериальных препаратов.

Показано, что гомоцикломагнирование тетрагидропирановых эфиров алкадиенолов **1** с помощью EtMgBr, катализируемое  $\text{Cr}_2\text{TiCl}_2$ , приводит к образованию магнезациклопентанов **2**, кислотный гидролиз которых дает диены **3** с выходами ~ 75 %. Последующим окислением диенов **3** с помощью реактива Джонса получены дикарбоновые кислоты **4**, содержащие в своей структуре 1Z,5Z-диеновый фрагмент с выходом ~ 50 % [1]. В дальнейшем каталитической этерификацией алкинолов с дикарбоновыми кислотами **4** с помощью N,N'-дициклогексилкарбодиимида (DCC) и 4-диметиламинопиридина (DMAP) получены симметричные диэфиры **5**, содержащие терминальные тройные связи. На заключительном этапе синтеза с применением реакции внутримолекулярного окислительного сочетания  $\alpha,\omega$ -диенов синтезированы целевые макродиолиды **6** с выходами 38–73 %.



[Ti] =  $\text{Cr}_2\text{TiCl}_2$ ; R = THP;  
[Cu] =  $\text{CuCl}_2$ ; n=2,3,5; m=1-4

Полученные макрокарбоциклы представляют интерес в качестве эффективных противоопухолевых, антибактериальных и противогрибковых препаратов для борьбы социально значимыми заболеваниями человека.

#### References

1. Catalytic cyclometallation in steroid chemistry III: Synthesis of steroidal derivatives of 5Z,9Z-dienoic acid and investigation of its human topoisomerase I inhibitory activity / V. A. D'yakonov [et al.] // Steroids. Elsevier, 2015. Vol. 102. P. 110–117.

*Работа выполнена при финансовой поддержке Российского фонда фундаментальных исследований (проект № 17-43-020502).*